



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2957280 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/198 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.07.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.04.17
(86)	European Application Nr.	15001790.3
(86)	European Filing Date	2015.06.17
(87)	The European Application's Publication Date	2015.12.23
(30)	Priority	2014.06.18, PL, 40860814
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Bonteque Consulting LTD, Craven House, Ground Floor 40-44 Uxbridge Road, London W5 2BS, Storbritannia
(72)	Inventor	Berdzinska, Katarzyna, ul. B. Graszynskiego 5/12, 62-095 Murowana Goslina, Polen Kieronska, Hanna, ul. Polnocna 9, 62-051 Wiry, Polen Milewski, Marek, ul. Andersena 37, 60-193 Poznan, Polen Nawrocka, Malgorzata, ul. Kolejowa 40/13, 60-718 Poznan, Polen Klepczynska, Marta, ul. Polna 3, 11-700 Mragowo, Polen
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	SOLID PHARMACEUTICAL COMPOSITION OF CYTISINE AND PROCESS FOR PREPARATION THEREOF
------	-------	---

(56)	References Cited:	EP-A1- 1 586 320 WO-A1-2014/076680 EP-A1- 2 233 134
------	----------------------	---

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Fast farmasøytisk sammensetning omfattende cytosin som en aktiv substans, **karakterisert ved at** sammensetningen ikke inneholder laktose og omfatter fra 20 til 75 vekt-% mikrokrySTALLinsk cellulose, glidemiddel og minst én farmasøytisk akseptabel hjelpestoff valgt fra gruppen omfattende: mannitol, kolloidalt silikondioksid, kalsiumhydrogenfosfat, hvor minst 60 % av cytosinpartiklene har størrelse fra 10 til 200 µm, og den farmasøytiske sammensetningen er i form av en tablett fremstilt ved direkte komprimeringsfremgangsmåte.
2. Sammensetning ifølge krav 1, omfattende cytosin som har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse d_{50} i området fra 10 µm til 30 µm.
3. Sammensetning ifølge krav 2, omfattende cytosin som har partikkelstørrelse d_{90} under 80 µm.
4. Sammensetning ifølge krav 1, **karakterisert ved at** vanninnholdet i sammensetningen er under 1 %.
5. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, omfattende:
 - a) fra 0,1 til 3 vekt-% av den aktive substansen;
 - b) fra 20 til 75 vekt-% mikrokrySTALLinsk cellulose;
 - c) fra 20 til 77,5 vekt-% fortynningsmiddel;
 - d) fra 0 til 10 vekt-% bindemiddel;
 - e) fra 0 til 5 vekt-% desintegrerende middel;
 - f) fra 0 til 2 vekt-% anti-adhesjonsmiddel;
 - g) fra 0,1 til 2,5 % glidemiddel.

6. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, **karakterisert ved at** anti-adhesjonsmidlet velges fra en gruppe omfattende: kolloidalt silisiumdioksid, hydrofilt dampet silika, talkum.

7. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, **karakterisert ved at** glidemidlet velges fra en gruppe omfattende: stearinsyre, magnesiumstearat, glycerylbehenat, natriumstearyl fumarat.

8. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene fra 1 til 5, **karakterisert ved at** bindemidlet er hydroksypropylmetylcellulose.

9. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene fra 1 til 8, som inneholder 1,5 mg cytosin i en enkelt tablett.

10. Fremgangsmåte for fremstilling av den faste farmasøytiske sammensetningen som inneholder cytosin som en aktivt substans ifølge krav 1, **karakterisert ved at:**

a) cytosin, hvor minst 60 % av partiklene har en størrelse fra 10 µm til 200 µm, i utgangspunktet blandes med mikrokrySTALLinsk cellulose som representerer fra 20 til 75 % av totalvekten av den endelige blandingen og eventuelt med fortynningsmidlene, bindemidlene, desintegreringsmidlene, anti-adhesjonsmidlene;

b) den resulterende blandingen siktes gjennom en sikt;

c) fortynningsmiddel valgt fra en gruppe omfattende: mannitol, kalsiumhydrogenfosfat, kolloidalt silisiumdioksid tilsettes;

d) glidemiddel valgt fra en gruppe omfattende: stearinsyre, magnesiumstearat, glycerylbehenat, natriumstearyl fumarat tilsettes og blandes fra 1 til 15 minutter;

e) eventuelt siktes den resulterende blandingen, den andre delen av glidemidlet velges fra en gruppe omfattende: stearinsyre, magnesiumstearat,

glycerylbehenat, natriumstearyl fumarat tilsettes og blandes fra 1 til 15 minutter;

f) den oppnådde blandingen tabletteres av den direkte kompresjonsprosessen.

11. Fremgangsmåten ifølge krav 10, hvor de oppnådde tablettene ytterligere avfuktes inntil de når vanninnhold under 1 %.

12. Fremgangsmåten ifølge krav 10 eller 11, hvor de oppnådde tablettene pakkes i plastbeholder, som gir beskyttelse mot fuktighet.

13. Sammensetning ifølge krav 1, **karakterisert ved at** sammensetningen er i form av preparat til oral bruk.